

Érvényesség: **1980.07.07 - 1984.03.28**

Bejelentés ügyszáma:	P8001690	Bejelentés napja:	19800707
Közzétételi szám:	30687	Közzététel napja:	19840328
Lajstromszám:	184797	Megadás meghirdetése:	19841029
Elsőbbségi adatok:	US055728 - 19790709, US142903 - 19800423		
NSZO:	<b>2170239/90</b>		

Magyar cím:

Eljárás kinazolin származékok előállítására

Angol cím:

PROCESS FOR PREPARING QUINAZOLINE DERIVATIVES

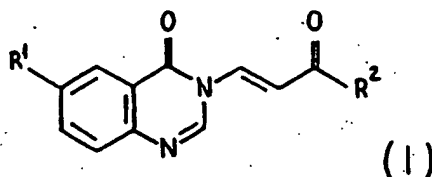
Bejelentő:

F. Hoffmann-La Roche et Co. Ag., Bazel, CH

Feltaláló:

LeMahieu, Ronald Andrew, North, Caldwell, N. J., US

Nason, William Chester, Mountain Lakes, N. J., US



Kivonat:

A találmány tárgya eljárás (I) általános képletű transz-3-(4-oxo-4H-kinazolin-3-il)-propénsav-származékok (mely képletben

R1 jelentése kis szénatomszámú alkil-, 3-5 szénatomos ciklóalkil-, kis szénatomszámú alkoxi- vagy hidroxilcsoport, halogénatom, kis szénatomszámú alkiltio-, kis szénatomszámú alkil-szulfonil-, kis szénatomszámú alkil-szulfonil-csoport, egy di-(C1-4)-alkil-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-O- általános képletű csoport, hidroxil-(kis szénatomszámú)-alkoxi- vagy trifluor-metil-csoport;

R2 jelentése hidroxil-, kis szénatomszámú alkoxi-, egy di-(C1-4)-alkil-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-O- általános képletű csoport vagy egy di-(C1-4)-alkil-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NH- általános képletű csoport és

n jelentése 2-4-ig terjedő egész szám) és gyógyászati lag alkalmas sóik előállítására.

Az (I) általános képletű vegyületeket a megfelelő, a 3-helyzetben helyettesítetlen 4-oxo-4H-kinazolin-származékok és 3-klór-akrilsav-származékok reakciójával állíthatjuk elő.

Az (I) általános képletű új vegyületek a gyógyászatban allergia-ellenes hatásuk révén alkalmazhatók.

BEST AVAILABLE COPY

## BEST AVAILABLE COPY

### Abstract:

The present invention relates to a process for the preparation of trans-3-(4-oxo-4H-quinazolin-3-yl)-propenic acid derivatives of the general formula (I) wherein

$R^1$  is lower alkyl,  $C_3$ - $C_5$  cycloalkyl, lower alkoxy, hydroxy, halo, lower alkylthio, lower alkylsulphanyl, lower alkylsulphonyl, a group of the general formula  $di-(C_1-C_4 \text{ alkyl})-N(CH_2)_n-O-$ , hydroxy-(lower alkoxy) or trifluoromethyl;

$R^2$  is hydroxy, lower alkoxy, a group of the general formula  $di-(C_1-C_4 \text{ alkyl})-N(CH_2)_n-O-$  or  $di-(C_1-C_4 \text{ alkyl})-N(CH_2)_n-NH-$ ;

$n$  is an integer from 2 to 4

and their pharmaceutically acceptable salts.

The compounds of the general formula (I) can be prepared by reacting a corresponding 3-unsubstituted 4-oxo-4H quinazoline derivative with a 3-chloroacrylic acid derivative.

The compounds of the general formula (I) possess useful antiallergenic activity. "